

PR-24

ПРЯМАЯ С-Н ФУНКЦИОНАЛИЗАЦИЯ В СИНТЕЗЕ НОВЫХ БОР-ОБОГАЩЕННЫХ АГЕНТОВ ДЛЯ МЕДИЦИНСКОЙ ХИМИИ

Е. И. Фомина¹, Л. А. Смышляева^{1,2}, М. В. Вараксин^{1,2}, Р. Ф. Фатыхов¹, И. А. Халымбаджа^{1,2},
В. Н. Чарушин^{1,2}, О. Н. Чупахин^{1,2}

¹Уральский федеральный университет им. первого Президента России Б. Н. Ельцина,
620002 Россия, Екатеринбург, ул. Мира, 19;

²Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского,
620041 Россия, Екатеринбург, ул. Софьи Ковалевской, 22.
E-mail: m.v.varaksin@urfu.ru

Азагетероциклические производные карборанов привлекают значительный интерес исследователей в области медицинской химии благодаря уникальным структурным и физико-химическим свойствам, что открывает широкие возможности для их практического применения в качестве агентов для бор-нейтрон-захватной терапии злокачественных новообразований, агонистов и антагонистов биологических мишеней, а также агентов для визуализации опухолей.

Одним из перспективных подходов для конструирования азагетероциклических производных карборана является методология прямой С-Н функционализации. Ранее нами был разработан универсальный однореакторный атом-экономический синтетический подход, основанный на прямой функционализации ароматических и неароматических N-оксидов фрагментом карбораниллития, выступающего в качестве нуклеофильного реагента. Данный подход позволяет синтезировать разнообразные азинилкарбораны, дигидрофталазинилкарбораны, имидазолилкарбораны и их N-оксид содержащие аналоги с хорошими выходами¹.

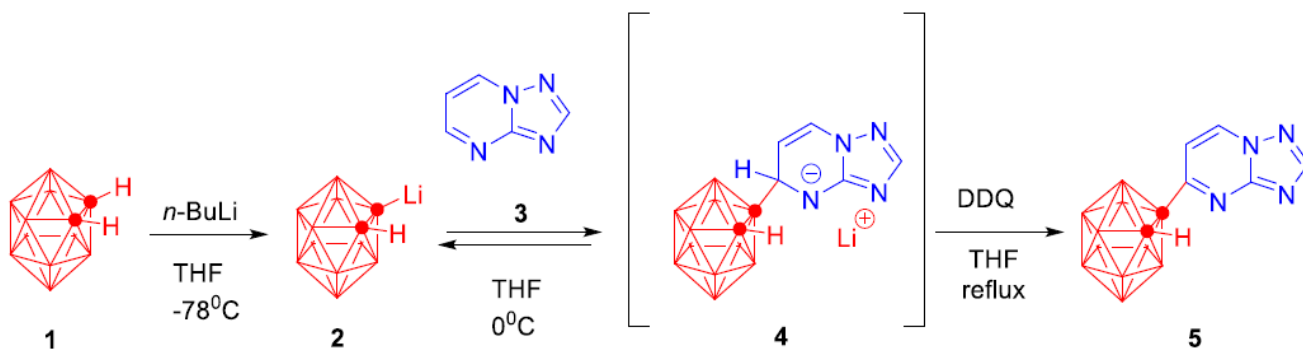


Схема 1 – Синтез карборан-содержащего производного триазолопиримидина

В настоящем исследовании было показано, что данный синтетический прием позволяет получить ранее неизвестные бор-обогащенные триазолопиримидины. Так, было установлено, что [1,2,4]триазоло[1,5-а]пиримидин **3** вступает в реакцию нуклеофильного замещения водорода (S_N^H) под действием карбораниллития **2**, генерируемого *in situ* и выступающего в качестве нуклеофильного реагента, в присутствии DDQ в качестве окислителя (схема 1).

Библиографический список

1. Azaheterocyclic Derivatives of ortho-Carborane: Synthetic Strategies and Application Opportunities / L. A. Smyshliaeva, M. V. Varaksin, V. N. Charushin [et al.] // Synthesis. – 2020. – Vol. 52. – P. 337–352.

Исследование проводилось при финансовой поддержке Министерства науки и высшего образования Российской Федерации (соглашение № 075-15-2020-777)